

⑨ 日本国特許庁 (JP) ⑩ 特許出願公開
 ⑪ 公開特許公報 (A) 昭55-124763

⑫ Int. Cl.³
 C 07 D 213/64
 213/70

識別記号 庁内整理番号
 7138-4C
 7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日
 発明の数 1
 審査請求 未請求

(全 3 頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

⑮ 特 願 昭54-32068
 ⑯ 出 願 昭54(1979)3月19日
 ⑰ 発明者 西山隆三
 高槻市真上町5丁目41番22号
 ⑱ 発明者 藤川政一
 守山市浮気町321番地の31
 ⑲ 発明者 横道歟
 草津市野村町221番地

⑳ 発明者 芳賀隆弘

草津市野村町221番地

㉑ 発明者 長谷邦昭

守山市浮気町321番地の31

㉒ 発明者 林弘仁

守山市浮気町321番地の31

㉓ 出願人 石原産業株式会社

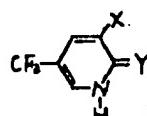
大阪市西区江戸堀1丁目3番11号

明細書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体

2. 特許請求の範囲

1. 一般式

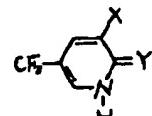


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

3. 発明の詳細な説明

本発明は医薬、農薬、染料などの中间原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

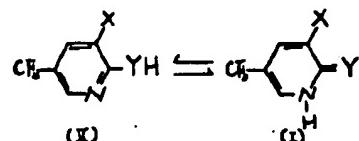
詳しくは本発明は一般式



(I)

(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。

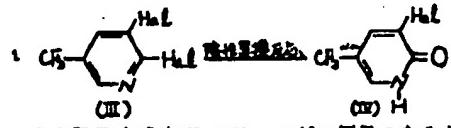


(式中X及びYは前述の通りである)

前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としては弗素、氯素、溴素、碘素が挙げられる。

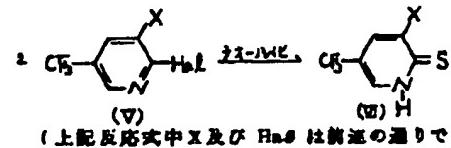
BEST AVAILABLE COPY

本発明の5-トリフォルオロメチル-2-ピリ
ン誘導体は通常、例えば下記方法によって製
造される。



(上記反応式中 Br_2 はハロゲン原子である)

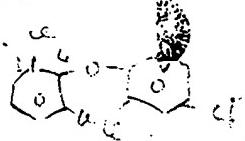
一般に上記反応はジノチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの非プロトン性極性溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのフルカリ水溶液を用いて50～150℃、0.1～10時間で行なわれる。



(上記反応式中 X 及び H₂S は前述の通りである)

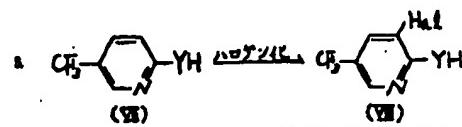
一般に上記反応はノタノール、エタノールなどのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの弱プロトン性極性溶

- 3 -



新嘉坡 55-124763(2)

鉛などの鉱物中、チオ尿素、硫化ソーダ、チオ硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50~70時間で行なわれる。



(上記反応式中の γ 及び H_2S は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、
酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒
などの溶媒中、種々ガス、臭素、チオニルクロ
ライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン
化剤を用いて0~100℃、0.5~10時間で
行なわれる。

本説明化合物は、例えばハロゲン化ニトロベンゼン類と結合させて 4-〔5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ〕ニトロベンゼン類を生成させ、これを還元して得られる 4-〔5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ〕アニリン類とベンゾイルイソシアネート

- 4 -

死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例 1 3-クロロ-5-トリフルオロメチ

ルーアーピリドン

[A]

5-トリフルオロノチル-2-ヒドロン₀
2フをクロロホルム20mlに溶解させ、50
℃に加温して塩素ガスを1時間搅拌下に通じ
た。反応終了後、クロロホルムを廃安し、ト
ルエン-ローヘキサンの混合浴媒で再結晶し
て融点144～147℃の目的物0.15gを得た。

{ B }

水酸化ナトリウム 2.4 g を水 1.25 ml に溶
解させた水溶液に 2,3-ジクロロ-5-トリ
フルオロノメチルヒドリン 4 g を加え、更にジ
メチルスルホキシド 1.25 ml を加えて加熱し、
110°C で 1 時間攪拌下に反応させた。反応
終了後生成物を放置し、重蒸留で酸性にして
沈殿物を得、このものを通過して目的物 2.5

ト類とを反応させることによりN-ベンゾイ
ル-N'-[4-[5-トリフルオロメチルビリ
ジン-2-イルオキシ]フェニル]ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ
ドンと3,4,5-トリクロロニトロベンゼンとを
結合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2
,6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-1,2,6-ジフルオロベンゾ
イル)-N'-(3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることがで
きる。このものは殺虫剤の有効成分として優
れた活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆蟲の
防除に有効であって、例えばこの化合物² 100
ppm水分散液にキバエツの卵片を浸漬し、それ
を風乾してそこへ2~3令のコナガの幼虫を放
ち、8日目に生死を判定した結果、100%の

- 8 -

- 6 -

を得た。

合成例 2 5-トリフルオロメチル-2-チオ
ビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルヒリジン 4 g とチオ尿素 1.67 g をエタノール 30 ml に溶解させ、加熱して還流状態で 3 時間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリウム水溶液 1.23 g を徐々に加えて還流状態で 1 時間反応させた。反応終了後、生成物を放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次いで、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレンを除去して融点 147~150 °C の目的物 2.1 g を得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフルオロメチル-2-ビリドン

5-トリフルオロメチル-2-ビリドン 0.4 g を希酸 10 ml に溶解させ、そこへ臭素 0.4 g を加えて攪拌下で 4 時間反応させた。反

特許昭55-124763(3)

反応終了後、酢酸を除去し、塩化メチレン 10 ml へキサンの混合溶媒で再結晶して融点 162~165 °C の目的物 0.45 g を得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-チオビリドン

2-クロロ-5-トリフルオロメチルヒリジン 4 g に代えて 2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルヒリジン 4.75 g を用いる以外は前記合成例 2 と同様にして反応を行ない、後処理を行なって融点 125~128 °C の目的物 1.9 g を得た。

特許出願人 石原産業株式会社

BEST AVAILABLE COPY